

1. Obydenov D.L., Röscenthaler G.-V., Sosnovskikh V. Ya. // Tetrahedron Lett. 2014. № 2. P. 472–474.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ в рамках научного проекта № 14-03-31925 мол_а.

РЕАКЦИЯ ГИДРОКСИЭТИЛИРОВАНИЯ NH И OH КИСЛОТ ЭТИЛЕНКАРБОНАТОМ

Чемезов А.И.⁽¹⁾, Пестов А.В.⁽²⁾

⁽¹⁾ Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

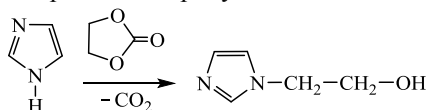
⁽²⁾ Институт органического синтеза УрО РАН
620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Имидазолсодержащие соединения в настоящее время нашли множество применений, в первую очередь, как биологически активные

препараты, обладающие широким спектром действия: бактерицидные, фунгицидные, и противоопухолевые. В промышленности производные имидазола применяются в качестве ингибиторов коррозии.

Данная работа посвящена изучению механизма взаимодействия имидазолсодержащих соединений с циклическими карбонатами.

Ранее нами было установлено, что имидазол и его производные вступают в реакцию с этиленкарбонатом, в результате которой образуются N-гидроксиэтилированные продукты с высоким выходом.



Для выявления особенностей химического строения субстрата, способного вступать в реакцию гидроксиалкилирования, были проведены реакции этиленкарбоната с рядом NH и OH кислот.

Гидроксиэтилирование NH и OH кислот

Субстрат	pK _a	Выход продукта гидроксиэтилирования, %
Бензотриазол	8,2	39
Фенол	9,9	0
1,2,4-Триазол	10,0	0
Бензимидазол	13,2	68
Бензамид	13,5	0
Имидазол	14,2	82
Метанол	16,0	14
Анилин	27,0	0
2-Метилимидазол	—	63
5-Метилимидазол	—	63
2-Аминоэтанол	—	0
N,N-Диметилэтилендиамин	—	42
Додециламин	10,6	70
3-(2-Пиридил)-1,2,4-триазинон-5	—	0
пара-Аминобензолсульфамид	—	0
Морфолин	8,7	58
N-Метилпиперазин	10,4	75

Все реакции проводились в среде толуола при кипячении в течение 5 часов. Строение полученных соединений было подтверждено с помощью ИК и ЯМР ^1H спектроскопии, газовой хроматографии с масс-

спектрометрической идентификацией и физико-химическими константами веществ.

Как следует из полученных данных, величина кислотности соединения по Бренстеду не является основным фактором, влияющим на возможность протекания процесса гидроксэтилирования, т. к. не наблюдается непрерывной области в значениях констант депротонирования, в которой все исследованные вещества подвергаются гидроксэтилированию.

Работа выполнена при финансовой поддержке гранта Президента РФ МК-7702.2015.3.

МОНО-, ДИ- И ТРИ(ГЕТ)АРИЛЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРИМИДИНЫ: СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ

Чепракова Е.М., Вербицкий Е.В., Русинов Г.Л., Чарушин В.Н.

Институт органического синтеза УрО РАН

620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Показано, что комбинация S_N^H -реакций и кросс-сочетания по Сузуки, промотируемого микроволновым излучением, является эффективной стратегией синтеза 4,5-ди(гет)арилзамещенных пиримидинов из исходного 5-бромпириимидина. В качестве нуклеофилов были использованы производные тиафена и пиррола.

Модификацией 2-хлорпириимидина в S_N^{ipso} -реакциях с морфолином и тиоморфолином и последующего бромирования (тио)морфолинозамещенных производных, получены 5-бром-2-(тио)морфолинопириимидины, которые стали исходными субстратами для синтеза 5-бром-2-(тио)морфолинопириимидинов, 5-(гет)арил-2-(тио)морфолинопириимидинов и 4,5-ди(гет)арил-2-(тио)морфолинопириимидинов в S_N^H -реакциях, реакциях кросс-сочетания по Сузуки и их комбинации соответственно.

Для всех полученных соединений исследована антибактериальная активность *in vitro* в отношении штаммов микобактерий туберкулеза *H₃₇Rv*, *avium*, *terrae* и с множественной лекарственной устойчивостью. Для наиболее активных из них показана низкая токсичность на белых мышах. Кроме того, несколько синтезированных пиримидинов проявили фунгистатическую активность в отношении некоторых видов дерматофитов.